

POWERED BY **Dialog**

**New pyrazole derivs useful as herbicides - e.g. methyl 3-(2,6-dichlorophenylsulphamoyl) 1-(4,6-dimethyl-pyrimidine-2-yl) pyrazole- 4-carboxylate**  
**Patent Assignee: NISSAN CHEM IND LTD**

**Patent Family**

Patent Number	Kind	Date	Application Number	Kind	Date	Week	Type
JP 6025177	A	19940201	JP 92182230	A	19920709	199409	B

**Priority Applications (Number Kind Date): JP 92182230 A ( 19920709)**

**Patent Details**

Patent	Kind	Language	Page	Main IPC	Filing Notes
JP 6025177	A		19	C07D-231/38	

**Abstract:**

JP 6025177 A

Pyrazole derivs. of formula (I) and their salts are new, where R1 = H, or 1-6C alkyl, 3-8C cycloalkyl, 2-7C alkenyl, 2-7C alkynyl, 1-6C alkylsulphonyl, di 1-6C alkylaminocarbonyl or di 1-6C alkylaminosulphonyl (each opt. substd.), or phenyl, thienyl, furyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,4-triazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, pyridyl, pyrimidyl, s-triazyl or 1,2,4-triazyl (each opt. substd.), or 1-6C alkyl substd. by phenyl wherein phenyl is opt. substd.; R2, R3 = e.g. H, or 1-6C alkyl, 2-7C alkenyl, 2-7C alkynyl, 1-6C alkylthio, 1-6C alkylsulphanyl or 1-6C alkylsulphonyl (each opt. substd.), or aminocarbonyl (opt. substd. by 1-6C alkoxy, 2-6C alkoxycarbonyl etc.), or 1-6C alkylaminocarbonyl, di 1-6C alkylaminocarbonyl, 1-6C alkylaminosulphonyl or di 1-6C alkylaminosulphonyl (each opt. substd.) or 1-6C alkoxy, 2-6C alkoxycarbonyl, 2-6C alkylcarbonyloxy, 2-6C alkoxycarbonylamino, amino substd. by mono or di 1-6C alkyl or 2-6C alkylcarbonyl (each opt. substd.), or -CR5=NO-R6, benzoyl, CN, OH, SH or NO2, or phenyl, phenoxy, thienyl, furyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,4-triazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, 1,3,4-oxadiazolyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazyl, pyrazyl, s-triazyl or 1,2,4-triazyl (each opt. substd.), or 1-6C alkyl substd. by phenyl wherein phenyl is opt. substd.; R5, R6 = 1-6C alkyl or alkoxy; R4 = 1-6C alkyl, 2-7C alkenyl, 2-7C alkynyl or 1-6C alkylthio (each opt. substd.), or phenyl, naphthyl, thienyl, furyl, pyrazolyl, imidazolyl, 1,2,4-triazolyl, thiazolyl, isothiazolyl, 1,3,4-thiadiazolyl, oxazolyl, isoxazolyl, oxadiazolyl, pyridyl, pyrimidyl, pyridazyl, pyrazyl, s-triazyl or 1,2,4-triazyl (each opt. substd.), or 1-6C alkyl substd. by phenyl wherein phenyl is opt. substd.; X = S(O)n, OS(O)n or NR7S(O)n; n = 0-2; R7 = H, 1-6C alkyl, 2-7C alkenyl, 2-7C alkynyl, 1-6C alkylsulphonyl or 1-6C alkylaminocarbonyl, or di 1-6C alkylaminocarbonyl, 1-6C alkylaminosulphonyl or di 1-6C alkylaminosulphonyl (each opt. substd.), 2-6C alkoxycarbonyl, 2-6C alkylcarbonyl or 1-6C alkyl substd. by phenyl wherein phenyl is opt. substd.

USE - (I) are herbicides.

(Dwg.0/0)



Derwent World Patents Index

© 2001 Derwent Information Ltd. All rights reserved.

Dialog® File Number 351 Accession Number 9792072



OK

40

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平6-25177

(43) 公開日 平成6年(1994)2月1日

(51) Int.Cl. <sup>5</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C 0 7 D 231/38				
A 0 1 N 43/56		D 8930-4H		
C 0 7 D 231/18				
403/04	2 3 1	8829-4C		

審査請求 未請求 請求項の数2(全19頁)

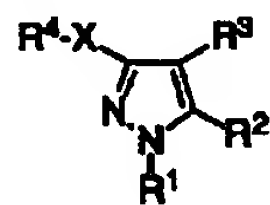
(21) 出願番号	特願平4-182230	(71) 出願人	000003986 日産化学工業株式会社 東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1
(22) 出願日	平成4年(1992)7月9日	(72) 発明者	馬場 正紀 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	大屋 栄一 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内
		(72) 発明者	近藤 康夫 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 ピラゾール誘導体及び除草剤

(57) 【要約】 (修正有)

【構成】 下記式(1) :



(1)

〔式中、XはS(O)、OS(O)、又はNR'S(O)を表し、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はH、アルキル基など、R<sup>4</sup>はアルキル基、アリール基など、R'はH、アルキル基など、nは0~2。〕で表されるピラゾール誘導体及び除草剤。

【効果】 上記化合物は、低薬量で水田及び畑の強害雑草に対し除草活性を示す。

3

ラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub> アルキル基を表す。)を表し、

XはS(O)<sub>n</sub>、OS(O)<sub>n</sub>又はNR<sup>7</sup>S(O)<sub>n</sub>。(nは0から2の整数を表し、R<sup>7</sup>は水素原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>2-7</sub>アルケニル基、C<sub>2-7</sub>アルキニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>アルキルアミノカルボニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルアミノスルホニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基(アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。))で表されるピラゾール誘導体又はその塩類。

【請求項2】 請求項1のピラゾール誘導体の1又は2以上を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は新規なピラゾール誘導体及び該誘導体を有効成分として含有する除草剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術及び課題】 従来、長年にわたる除草剤の研究開発の中から多種多様な薬剤が実用化され、これらの除草剤は雑草防除作業の省力化や農園芸作物の生産性向上に寄与してきた。今日においても、より卓越した除草特性を有する新規薬剤の開発が要望され、特に農園芸用除草剤としては栽培作物に薬害を及ぼすことなく対象雑草のみを選択的にかつ低薬量で防除し得ることが望ましいが、既存の薬剤は必ずしも好適な除草特性を有するものではない。

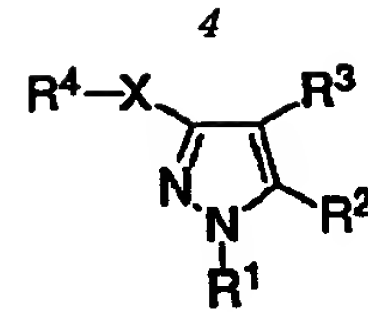
【0003】 一方、トリアゾールスルホンアミド系化合物のある特定の化合物に除草活性があることが知られており、例えば、特開昭63-22083号公報に記載されている。また、N-カルバモイルトリアゾール系化合物のある特定の化合物に除草活性があることが知られており、例えば、西ドイツ国特許第2132618号、米国特許第4280831号、特開昭59-39880号公報、特開平2-1481号公報に記載されている。またスルホニルアミノピラゾール系化合物が特開平1-268685号公報の請求範囲に記載されている。

【0004】

【課題を解決するための手段】 本発明は、式(1)：

【0005】

【化2】



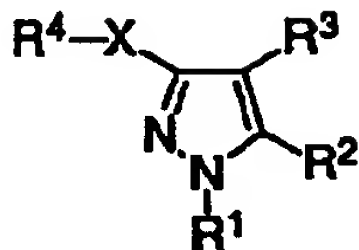
【0006】 [式中、R<sup>1</sup>は水素原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基(aはハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基、シアノ基及びニトロ基から1又は2以上選ばれる置換基を表す。)、aによって置換されてもよいC<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルケニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルキニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノカルボニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル基、bによって置換されてもよいフェニル基(bはC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>2-6</sub>ハロゲノアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、フェニル基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、フェノキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルコキシアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、シアノ基及びニトロ基から1又は2以上選ばれる置換基を表す。)、bによって置換されてもよい芳香族複素環基(芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1,2,4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1,3,4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1,3,4-オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1,2,4-トリアジル基を表す。)]又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基(アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。))を表し、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれ独立して水素原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルケニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルキニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキ

1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(1)：

【化1】



〔式中、R<sup>1</sup> は水素原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基(aはハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基、シアノ基及びニトロ基から1又は2以上選ばれる置換基を表す。)、aによって置換されてもよいC<sub>3-6</sub>シクロアルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルケニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルキニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノカルボニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル基、bによって置換されてもよいフェニル基(bはC<sub>1-6</sub>アルキル基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルケニル基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルケニル基、C<sub>2-6</sub>アルキニル基、フェニル基、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキニルオキシ基、フェノキシ基、C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキルチオ基、C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub>ハロゲノアルキルスルホニル基、C<sub>2-6</sub>アルコキシアルキル基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基、ベンゾイル基、シアノ基及びニトロ基から1又は2以上選ばれる置換基を表す。)、bによって置換されてもよい芳香族複素環基(芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1, 3, 4-オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1, 2, 4-トリアジル基を表す。)又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基(アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。))を表し、

R<sup>2</sup> 及びR<sup>3</sup> はそれぞれ独立して水素原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルケニル基、aによって置換されて

2

もよいC<sub>2-7</sub>アルキニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルフィニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、置換されてもよいアミノカルボニル基(置換基はC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、C<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基及びシアノ基から選ばれる)、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルアミノカルボニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキルアミノスルホニル基、ジ(aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル)アミノスルホニル基、ハロゲン原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub>アルコキシカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルオキシ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub>アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub>アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub>アルキルカルボニル基、-CR<sup>5</sup>=NO-R<sup>6</sup>基(R<sup>5</sup> 及びR<sup>6</sup> はそれぞれ独立してC<sub>1-6</sub>アルキル基もしくはC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を表す。)、ベンゾイル基、シアノ基、ヒドロキシ基、メルカプト基、ニトロ基、bによって置換されてもよいフェニル基、bによつ置換されてもよいフェノキシ基、bによって置換されてもよい芳香族複素環基(芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1, 3, 4-オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1, 2, 4-トリアジル基を表す。)又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基(アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す。))を表し、R<sup>4</sup> はaによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルケニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub>アルキニル基、bによって置換されてもよいアリール基(アリール基はフェニル基又はナフチル基を表す。)、bによって置換されてもよい芳香族複素環基(芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1, 2, 4-トリアジル基を表す。)又はbによつてフェニル基が置換されてもよいアラルキル基(ア



5

ルスルホニル基、置換されてもよいアミノカルボニル基（置換基はC<sub>1-6</sub> アルコキシ基、C<sub>2-6</sub> アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルキルカルボニルオキシ基、C<sub>2-6</sub> アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub> アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、C<sub>2-6</sub> アルキルカルボニル基及びシアノ基から選ばれる）、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジ（aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル）アミノカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキルアミノスルホニル基、ジ（aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル）アミノスルホニル基、ハロゲン原子、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルコキシ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub> アルコキシカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub> アルキルカルボニルオキシ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub> アルキルカルボニルアミノ基、同一もしくは異なるC<sub>1-6</sub> アルキル基によって1ないし2置換されたアミノ基、aによって置換されてもよいC<sub>2-6</sub> アルキルカルボニル基、 $-CR^5=NO-R^6$  基（R<sup>5</sup> 及びR<sup>6</sup> はそれぞれ独立してC<sub>1-6</sub> アルキル基もしくはC<sub>1-6</sub> アルコキシ基を表す。）、ベンゾイル基、シアノ基、ヒドロキシル基、メルカプト基、ニトロ基、bによって置換されてもよいフェニル基、bによって置換されてもよいフェノキシ基、bによって置換されてもよい芳香族複素環基（芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、1, 3, 4-オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1, 2, 4-トリアジル基を表す。）又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基（アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub> アルキル基を表す。）を表し、R<sup>4</sup> はaによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub> アルケニル基、aによって置換されてもよいC<sub>2-7</sub> アルキニル基、bによって置換されてもよいアリール基（アリール基はフェニル基又はナフチル基を表す。）、bによって置換されてもよい芳香族複素環基（芳香族複素環基はチエニル基、フリル基、ピラゾリル基、イミダゾリル基、1, 2, 4-トリアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、1, 3, 4-チアジアゾリル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、オキサジアゾリル基、ピリジル基、ピリミジル基、ピリダジル基、ピラジル基、S-トリアジル基又は1, 2, 4-トリアジル基を表す。）又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基（アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub> アルキル基を表す。）を表し、XはS(O)、OS(O)、又はNR<sup>7</sup>S(O)。(nは0から2の整数を表し、R<sup>7</sup> は水素原子、C

6

1-6 アルキル基、C<sub>2-7</sub> アルケニル基、C<sub>2-7</sub> アルキニル基、C<sub>1-6</sub> アルキルスルホニル基、C<sub>1-6</sub> アルキルアミノカルボニル基、ジ（aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル）アミノカルボニル基、aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキルアミノスルホニル基、ジ（aによって置換されてもよいC<sub>1-6</sub> アルキル）アミノスルホニル基、C<sub>2-6</sub> アルコキシカルボニル基、C<sub>2-6</sub> アルキルカルボニル基又はbによってフェニル基が置換されてもよいアラルキル基（アラルキル基はフェニル基によって置換されたC<sub>1-6</sub> アルキル基を表す。）〕で表されるピラゾール誘導体又はその塩類（以下、本発明化合物という）、及びそれらの1又は2以上を含有することを特徴とする除草剤に関するものである。

【0007】本発明化合物の式(1)の置換基R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びXの一例として次のようなものが挙げられる。但し本発明化合物はこれに限定されるものではない。

R<sup>1</sup>：水素原子；メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-アミル、s-アミル、t-アミル、n-ヘキシルなどのアルキル基；シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどのシクロアルキル基；ビニル、アリル、2-ブテニル、3-ブテニル、4-ブテニル、イソプロベニルなどのアルケニル基；プロパギルなどのアルキニル基；アセチル、プロピオニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、t-ブチルカルボニルなどのアルキルカルボニル基；メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基；ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジ-n-プロピルアミノカルボニル、ジ-i-プロピルアミノカルボニルなどのジアルキルアミノカルボニル基；メタンスルホニル、エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基；フェニル、1-ナフチル、2-ナフチルなどのアリール基；2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-チエニル、3-チエニル、2-フリル、3-フリル、3-ピラゾリル、4-ピラゾリル、5-ピラゾリル、2-イミダゾリル、4-イミダゾリル、5-イミダゾリル、3-(1,2,4-トリアゾリル)、5-(1,2,4-トリアゾリル)、2-ピリミジル、4-ピリミジル、5-ピリミジル、3-ピリダジル、4-ピリダジル、2-ピラジル、s-トリアジル、3-(1,2,4-トリアジル)、5-(1,2,4-トリアジル)、6-(1,2,4-トリアジル)、2-チアゾリル、4-チアゾリル、5-チアゾリル、3-イソチアゾリル、4-イソチアゾリル、5-イソチアゾリル、2-(1,3,4-チアジアゾリル)、3-(1,2,4-チアジアゾリル)、5-(1,2,4-チアジアゾリル)、5-(1,2,3-チアジアゾリル)、2-オキサゾリル、4-オキサゾリル、5-



オキサゾリル, 3-イソオキサゾリル, 4-イソオキサゾリル, 5-イソオキサゾリル, 2-(1,3,4-オキサジアゾリル), 3-(1,2,4-オキサジアゾリル), 5-(1,2,4-オキサジアゾリル), 5-(1,2,3-オキサジアゾリル)などの複素環基;ベンジル,  $\alpha$ -メチルベンジル,  $\alpha$ -エチルベンジル,  $\alpha$ -n-プロピルベンジル,  $\alpha$ -イソプロピルベンジル,  $\alpha$ -n-ブチルベンジル, クミル,  $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジエチルベンジルなどのアラルキル基;

【0008】アリール基、複素環基及びアラルキル基に対する置換基:フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素などのハロゲン原子;メトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, i-プロポキシ, t-ブトキシなどアルコキシ基;シアノ基;メトキシカルボニル, エトキシカルボニル, n-プロポキシカルボニル, i-プロポキシカルボニル, t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基;ジメチルアミノ, ジエチルアミノ, ジ-n-プロピルアミノ, ジ-i-プロピルアミノなどのジアルキルアミノ基;ニトロ基;メチル, エチル, n-プロピル, i-プロピル, n-ブチル, i-ブチル, s-ブチル, t-ブチルなどのアルキル基;トリフロロメチル, トリクロロメチルなどのハロゲン化アルキル基;トリフロロメトキシ, ジフロロメトキシなどのハロゲン化アルキルオキシ基;トリフロロメチルチオ, ジフロロメチルチオなどのハロゲン化アルキルチオ基;トリフロロメチルスルホニルなどのハロゲン化アルキルスルホニル基;メチルメルカプト, エチルメルカプト, n-プロピルメルカプトなどのアルキルチオ基;メタンスルホニル, エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基;メトキシメチル, エトキシメチルなどのアルコキシアルキル基;アリル, 2-ブテニル, 3-ブテニル, 4-ブテニル, イソプロベニルなどのアルケニル基;プロパギルなどのアルキニル基.

【0009】R<sup>2</sup>:メチル, エチル, n-プロピル, i-プロピル, n-ブチル, i-ブチル, s-ブチル, t-ブチル, n-アミル, i-アミル, s-アミル, t-アミル, n-ヘキシルなどのアルキル基;アリル, 2-ブテニル, 3-ブテニル, 4-ブテニルなどのアルケニル基;プロパギルなどのアルキニル基;メトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, i-プロポキシ, n-ブトキシなどのアルコキシ基;水素原子;フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素などのハロゲン原子;シアノ基;アミノ基;ヒドロキシ基;アセチルオキシ, プロピオニルオキシなどのアルキルカルボニルオキシ基;アセチルアミノ, プロピオニルアミノなどのアルキルカルボニルアミノ基;ジメチルアミノ, ジエチルアミノなどのジアルキルアミノ基;メチルメルカプト, エチルメルカプト, n-プロピルメルカプトなどのアルキルチオ基;メタンスルホニル, エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基;フェニル基などのアリール基;2-ピリジル, 2-ピリミ

ジルなどの複素環基.

【0010】R<sup>3</sup>:メチル, エチル, n-プロピル, i-プロピル, n-ブチル, i-ブチル, s-ブチル, t-ブチル, n-アミル, s-アミル, t-アミル, n-ヘキシルなどのアルキル基;ビニル, アリル, 2-ブテニル, 3-ブテニル, 4-ブテニル, イソプロベニルなどのアルケニル基;プロパギルなどのアルキニル基;水素原子;フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素などのハロゲン原子;シアノ基;ニトロ基;アミノ基;アセチルアミノ, プロピオニルアミノなどのアルキルカルボニルアミノ基;ジメチルアミノ, ジエチルアミノなどのジアルキルアミノ基;メチルメルカプト, エチルメルカプト, n-プロピルメルカプトなどのアルキルチオ基;メタンスルホニル, エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基;メトキシカルボニル, エトキシカルボニル, n-プロポキシカルボニル, i-プロポキシカルボニル, t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基;アセチル, プロピオニル, n-プロピルカルボニル, i-プロピルカルボニル, t-ブチルカルボニルなどのアルキルカルボニル基;2-メトキシイミノエチル基, 2-エトキシイミノエチル基などのアルコキシイミノアルキル基;フェニル, 1-ナフチル, 2-ナフチルなどのアリール基;2-ピリジル, 3-ピリジル, 4-ピリジル, 2-チエニル, 3-チエニル, 2-フリル, 3-フリル, 3-ピラゾリル, 4-ピラゾリル, 5-ピラゾリル, 2-イミダゾリル, 4-イミダゾリル, 5-イミダゾリル, 3-(1,2,4-トリアゾリル), 5-(1,2,4-トリアゾリル), 2-ピリミジル, 4-ピリミジル, 5-ピリミジル, 3-ピリダジル, 4-ピリダジル, 2-ピラジル, s-トリアジル, 3-(1,2,4-トリアジル), 5-(1,2,4-トリアジル), 6-(1,2,4-トリアジル), 2-チアゾリル, 4-チアゾリル, 5-チアゾリル, 3-イソチアゾリル, 4-イソチアゾリル, 5-イソチアゾリル, 2-(1,3,4-チアジアゾリル), 3-(1,2,4-チアジアゾリル), 5-(1,2,4-チアジアゾリル), 5-(1,2,3-チアジアゾリル), 2-オキサゾリル, 4-オキサゾリル, 5-オキサゾリル, 3-イソオキサゾリル, 4-イソオキサゾリル, 5-イソオキサゾリル, 2-(1,3,4-オキサジアゾリル), 3-(1,2,4-オキサジアゾリル), 5-(1,2,4-オキサジアゾリル), 5-(1,2,3-オキサジアゾリル)などの複素環基;ベンジル,  $\alpha$ -メチルベンジル,  $\alpha$ -エチルベンジル,  $\alpha$ -n-プロピルベンジル,  $\alpha$ -イソプロピルベンジル,  $\alpha$ -n-ブチルベンジル, クミル,  $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジエチルベンジルなどのアラルキル基;

【0011】アリール基、複素環基及びアラルキル基に対する置換基:フッ素, 塩素, 臭素, ヨウ素などのハロゲン原子;メトキシ, エトキシ, n-プロポキシ, i-プロポキシ, t-ブトキシなどアルコキシ基;シアノ

基；アリルオキシ，2-ブテニルオキシ，3-ブテニルオキシ，4-ブテニルオキシなどのアルケニルオキシ基；プロパギルオキシなどのアルキニルオキシ基；メトキシカルボニル，エトキシカルボニル，n-プロポキシカルボニル，i-プロポキシカルボニル，t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基；アセチルオキシ，プロピオニルオキシなどのアルキルカルボニルオキシ基；アセチルアミノ，プロピオニルアミノなどのアルキルカルボニルアミノ基；ジメチルアミノ，ジエチルアミノ，ジ-n-プロピルアミノ，ジ-i-プロピルアミノなどのジアルキルアミノ基；アセチル，プロピオニル，n-プロピルカルボニル，i-プロピルカルボニル，t-ブチルカルボニルなどのアルキルカルボニル基；ニトロ基；メチル，エチル，n-プロピル，i-プロピル，n-ブチル，i-ブチル，s-ブチル，t-ブチルなどのアルキル基；トリフロロメチル，トリクロロメチルなどのハロゲン化アルキル基；トリフロロメトキシ，ジフロロメトキシなどのハロゲン化アルキルオキシ基；トリフロロメチルチオ，ジフロロメチルチオなどのハロゲン化アルキルチオ基；トリフロロメチルスルホニルなどのハロゲン化アルキルスルホニル基；メチルメルカプト，エチルメルカプト，n-プロピルメルカプトなどのアルキルチオ基；メタンスルホニル，エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基；メトキシメチル，エトキシメチルなどのアルコキシアルキル基；アリル，2-ブテニル，3-ブテニル，4-ブテニル，イソプロベニルなどのアルケニル基；プロパギルなどのアルキニル基；2-クロロアリル，3-クロロアリル，2,3-ジクロロアリル，3,3-ジクロロアリル，2,3,3-トリクロロアリルなどのハロゲン化アルケニル基；プロパギルなどのアルキニル基；ベンゾイル基；フェニル基；フェノキシ基。

【0012】R<sup>4</sup>：メチル，エチル，n-プロピル，i-プロピル，n-ブチル，i-ブチル，s-ブチル，t-ブチル，n-アミル，s-アミル，t-アミル，n-ヘキシルなどのアルキル基；ビニル，アリル，2-ブテニル，3-ブテニル，4-ブテニル，イソプロベニル，ゲラニル，シトロネリルなどのアルケニル基；プロパギルなどのアルキニル基；フェニル，1-ナフチル，2-ナフチルなどのアリール基；2-ピリジル，3-ピリジル，4-ピリジル，2-チエニル，3-チエニル，2-フリル，3-フリル，3-ピラゾリル，4-ピラゾリル，5-ピラゾリル，2-イミダゾリル，4-イミダゾリル，5-イミダゾリル，3-(1,2,4-トリアゾリル)，5-(1,2,4-トリアゾリル)，2-ピリミジル，4-ピリミジル，5-ピリミジル，3-ピリダジル，4-ピリダジル，2-ピラジル，s-トリアジル，3-(1,2,4-トリアジル)，5-(1,2,4-トリアジル)，6-(1,2,4-トリアジル)，2-チアゾリル，4-チアゾリル，5-チアゾリル，3-イソチアゾリ

ル，4-イソチアゾリル，5-イソチアゾリル，2-(1,3,4-チアジアゾリル)，3-(1,2,4-チアジアゾリル)，5-(1,2,4-チアジアゾリル)，5-(1,2,3-チアジアゾリル)，2-オキサゾリル，4-オキサゾリル，5-オキサゾリル，3-イソオキサゾリル，4-イソオキサゾリル，5-イソオキサゾリル，2-(1,3,4-オキサジアゾリル)，3-(1,2,4-オキサジアゾリル)，5-(1,2,4-オキサジアゾリル)，5-(1,2,3-オキサジアゾリル)などの複素環基；ベンジル，α-メチルベンジル，α-エチルベンジル，α-n-プロピルベンジル，α-イソプロピルベンジル，α-n-ブチルベンジル，クミル，α，α-ジエチルベンジルなどのアラルキル基；

【0013】アルキル基，アルケニル基，アルキニル基に対する置換基：フッ素，塩素，臭素，ヨウ素などのハロゲン原子；メトキシ，エトキシ，n-プロポキシ，i-プロポキシ，t-ブトキシなどのアルコキシ基；シアノ基；メトキシカルボニル，エトキシカルボニル，n-プロポキシカルボニル，i-プロポキシカルボニル，t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基；アセチルオキシ，プロピオニルオキシなどのアルキルカルボニルオキシ基；アセチルアミノ，プロピオニルアミノなどのアルキルカルボニルアミノ基；ジメチルアミノ，ジエチルアミノ，ジ-n-プロピルアミノ，ジ-i-プロピルアミノなどのジアルキルアミノ基；アセチル，プロピオニル，n-プロピルカルボニル，i-プロピルカルボニル，t-ブチルカルボニルなどのアルキルカルボニル基；ニトロ基；

【0014】アリール基，複素環基及びアラルキル基に対する置換基：フッ素，塩素，臭素，ヨウ素などのハロゲン原子；メトキシ，エトキシ，n-プロポキシ，i-プロポキシ，t-ブトキシなどアルコキシ基；シアノ基；アリルオキシ，2-ブテニルオキシ，3-ブテニルオキシ，4-ブテニルオキシなどのアルケニルオキシ基；プロパギルオキシなどのアルキニルオキシ基；メトキシカルボニル，エトキシカルボニル，n-プロポキシカルボニル，i-プロポキシカルボニル，t-ブトキシカルボニルなどのアルコキシカルボニル基；アセチルオキシ，プロピオニルオキシなどのアルキルカルボニルオキシ基；アセチルアミノ，プロピオニルアミノなどのアルキルカルボニルアミノ基；ジメチルアミノ，ジエチルアミノ，ジ-n-プロピルアミノ，ジ-i-プロピルアミノなどのジアルキルアミノ基；アセチル，プロピオニル，n-プロピルカルボニル，i-プロピルカルボニル，t-ブチルカルボニルなどのアルキルカルボニル基；ニトロ基；メチル，エチル，n-プロピル，i-プロピル，n-ブチル，i-ブチル，s-ブチル，t-ブチルなどのアルキル基；トリフロロメチル，トリクロロメチルなどのハロゲン化アルキル基；トリフロロメトキシ，ジフロロメトキシなどのハロゲン化アルキルオキシ

11

基；トリフロロメチルチオ，ジフロロメチルチオなどのハロゲン化アルキルチオ基；トリフロロメチルスルホニルなどのハロゲン化アルキルスルホニル基；メチルメルカプト，エチルメルカプト， $n$ -プロピルメルカプトなどのアルキルチオ基；メタンスルホニル，エタンスルホニルなどのアルキルスルホニル基；メトキシメチル，エトキシメチルなどのアルコキシアルキル基；アリル，2-ブテニル，3-ブテニル，4-ブテニル，イソプロペニルなどのアルケニル基；プロパルギルなどのアルキニル基；2-クロロアリル，3-クロロアリル，2,3-ジクロロアリル，3,3-ジクロロアリル，2,3,3-トリクロロアリルなどのハロゲン化アルケニル基；プロパルギ

12

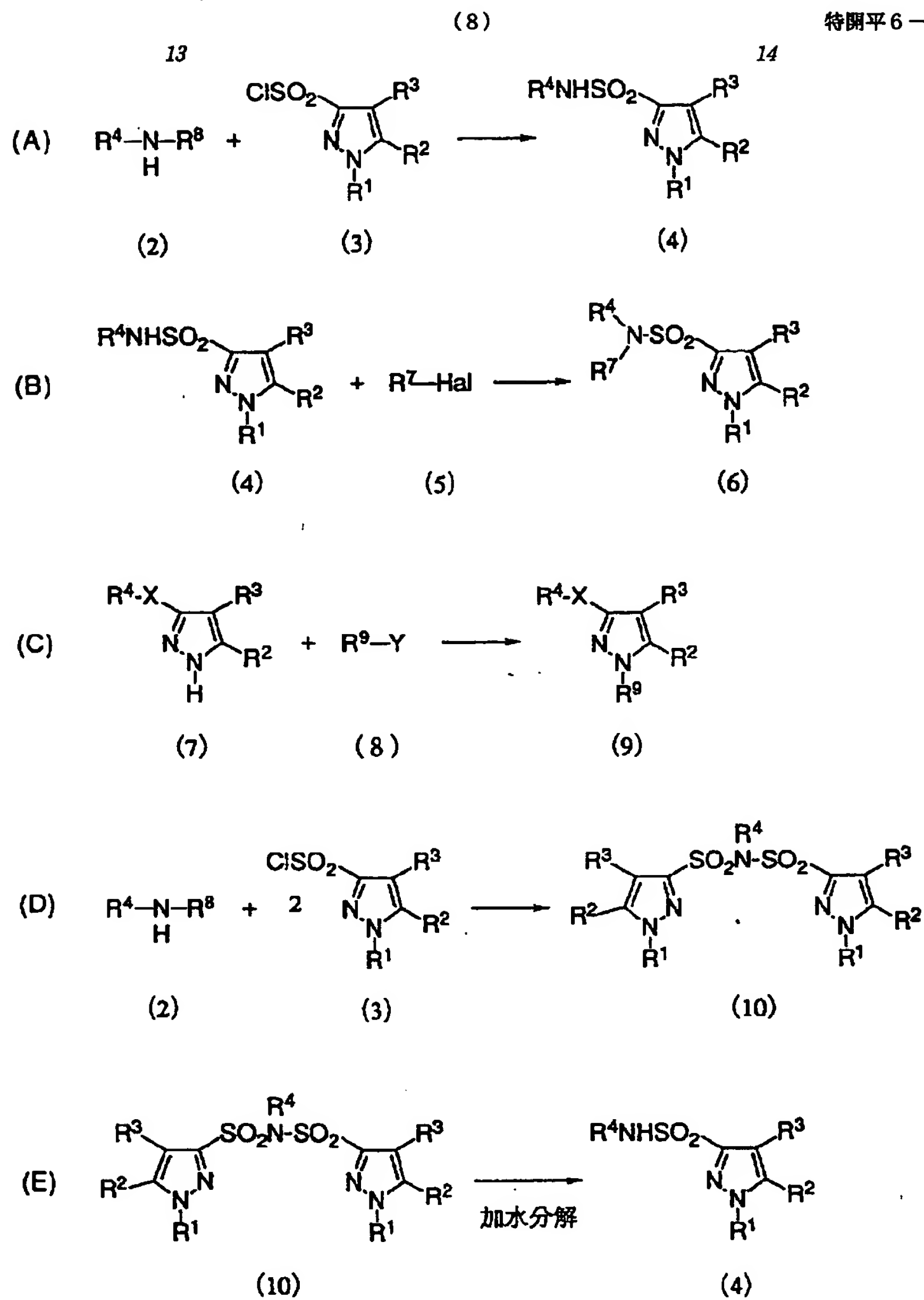
ルなどのアルキニル基；ベンゾイル基；フェニル基；フェノキシ基。

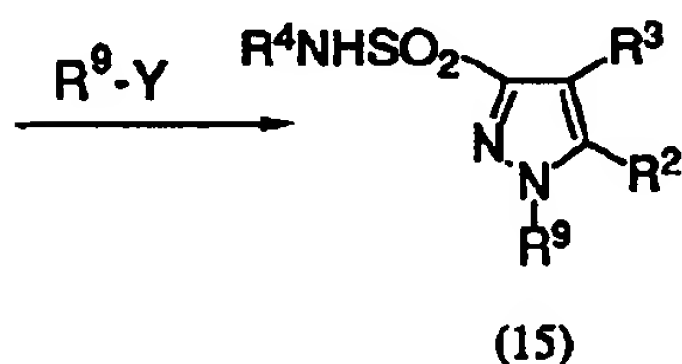
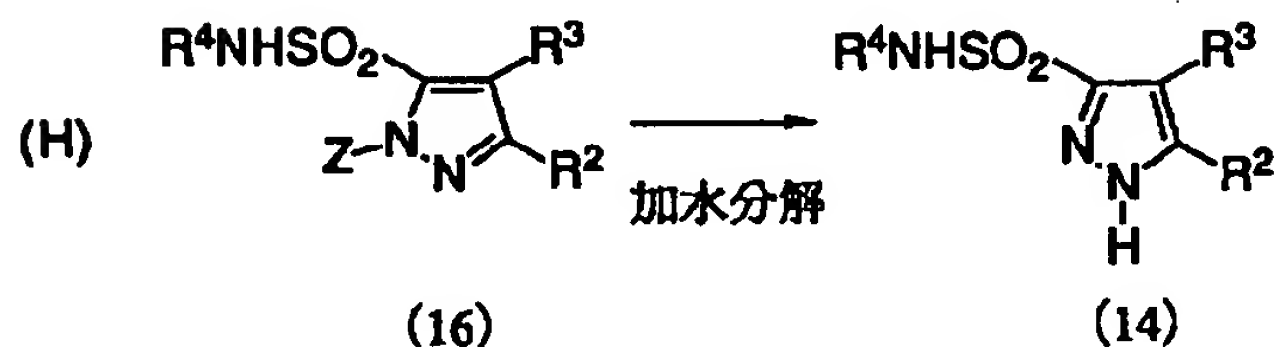
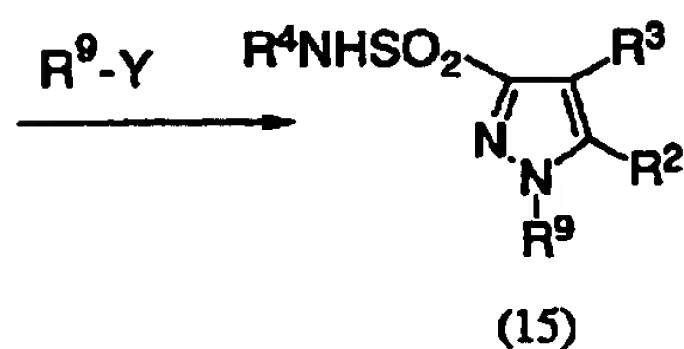
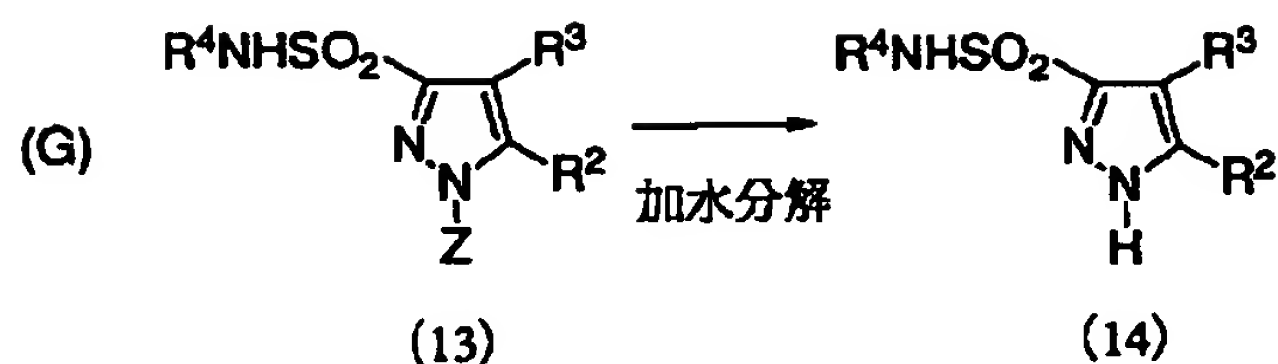
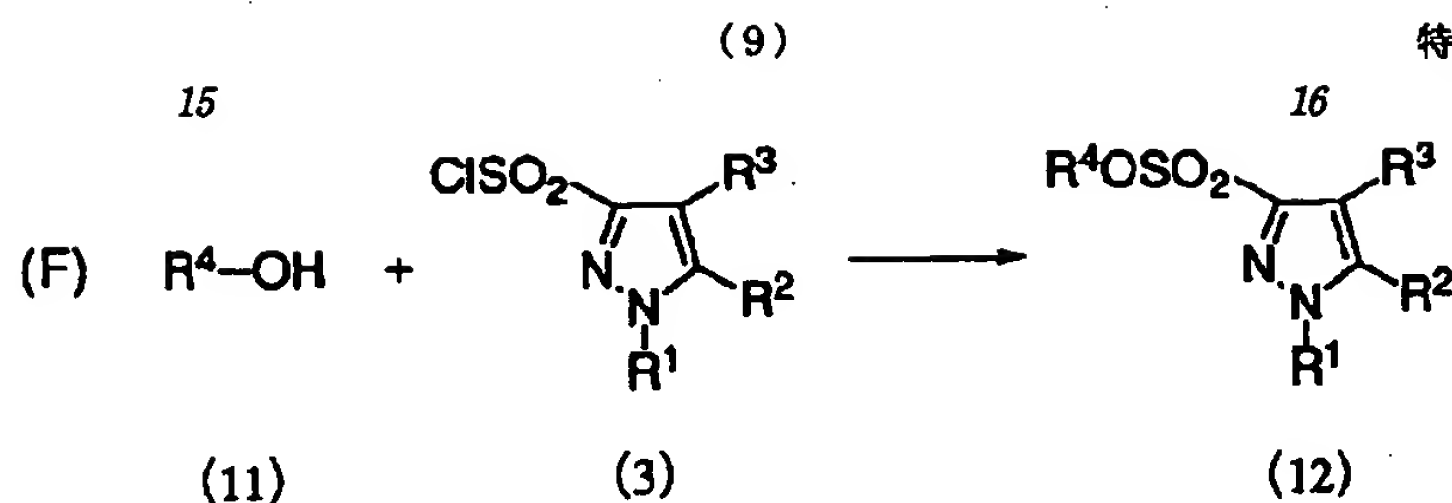
【0015】X：S，SO，SO<sub>2</sub>，OSO<sub>2</sub>，NHSO<sub>2</sub>。

【0016】本発明化合物は、イネ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、オオムギ、ソルガム、ワタなどの作物に対してすぐれた選択性を有し、かつ低薬量で水田及び畑の強害雑草に対しすぐれた除草活性を示す。本発明化合物は次のような合成法で容易に製造できる。

【0017】

【化3】





【0019】〔式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $X$ 及び $n$ は前記と同じ意味を表し、 $R^6$ は、水素原子又はトリメチルシリル基を表し、 $R^7$ は $R^1$ と同様の意味を表す。但し、 $R^6$ は水素原子を除く。 $Hal$ はハロゲン原子を表し、 $Y$ はハロゲン原子、メタンスルホニル基又はベンジルスルホニル基を表し、 $Z$ はメチル基又はメトキシ基で置換されていてもよい2-ピリジル、4-ピリジル、2-ピリミジル、4-ピリミジル又はs-トリアル基を表す。〕

【0020】(A)及び(F)で示される反応は、通常溶媒中、式(3)に対して0.9~2.0倍モルの塩基

の存在下で行なわれる。溶媒は反応に不活性であればよく、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ピリジン、トリエチルアミン、 $N,N$ -ジメチルアニリンのような有機塩基、酢酸エチル、酢酸メチルのようなエステル類、アセトニトリル、 $N,N$ -ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどが挙げられる。

【0021】塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウムなどの無機塩類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、4-N,N-ジメチルピリジンなどの有機塩類が挙げられる。反応温度は-50℃から200℃で可能であるが、操作上溶媒の凝固点から沸点までが好ましい。

【0022】反応時間は、反応条件によるが、通常5分～100時間で完結する。(B)で示される反応は、通常溶媒中、式(4)に対して1.0～2.0倍モルの塩基の存在下で行なわれる。溶媒は反応に不活性であればよく、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基、酢酸エチル、酢酸メチルのようなエステル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどが挙げられる。

【0023】塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウムなどの無機塩類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、4-N,N-ジメチルピリジンなどの有機塩類が挙げられる。反応温度は-50℃から200℃で可能であるが、操作上溶媒の凝固点から沸点までが好ましい。

【0024】反応時間は、反応条件によるが、通常5分～100時間で完結する。(C)、(G)及び(H)で示される反応は、通常溶媒中、式(7)に対して0.9～2.0倍モルの塩基の存在下で行なわれる。使用される溶媒は、反応に不活性であればよく、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基、酢酸エチル、酢酸メチルのようなエステル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどが挙げられる。

【0025】塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウムなどの無機塩類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、4-N,N-ジメ

チルピリジンなどの有機塩類が挙げられる。反応温度は-50℃から200℃で可能であるが、操作上溶媒の凝固点から沸点までが好ましい。

【0026】反応時間は、反応条件によるが、通常5分～100時間で完結する。(D)で示される反応は、通常溶媒中、式(3)に対して2.0～4.0倍モルの塩基の存在下で行なわれる。使用される溶媒は、反応に不活性でよく、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素、ジクロロエタン、トリクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼンのような芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフランのようなエーテル類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基、酢酸エチル、酢酸メチルのようなエステル類、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどが挙げられる。

【0027】塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウムなどの無機塩類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、4-N,N-ジメチルピリジンなどの有機塩類が挙げられる。反応温度は-50℃から200℃で可能であるが、操作上溶媒の凝固点から沸点までが好ましい。

【0028】反応時間は、反応条件によるが、通常5分～100時間で完結する。(E)、(G)及び(H)で示される加水分解反応は、通常溶媒中、それぞれ式(10)、式(13)及び式(16)に対して1.0～4.0倍モルの塩基の存在下で行なわれる。使用される溶媒は水又は水と有機溶媒との混合物であり、有機溶媒としては、メタノール、エタノールのようなアルコール類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリンのような有機塩基、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどが挙げられる。

【0029】塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭素カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウムなどの無機塩類、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリン、4-N,N-ジメチルピリジンなどの有機塩類が挙げられる。反応温度は-50℃から200℃で可能であるが、操作上溶媒の凝固点から沸点までが好ましい。

【0030】反応時間は、反応条件によるが、通常5分～100時間で完結する。反応終了後は常法の後処理を行ない、もし必要であれば、再結晶、カラムクロマトグラフィー等により精製できる。式(3)で表されるピラゾールスルホニルクロライド系化合物及び式(16)で表される化合物は、例えば、アクタ・ヘミカ・スカンジ



ナビカ (Acta. Chem. Scand.), 24, p. 1191 (1970)、ヘミツシェ・ペリヒテ (Chem. Ber.), 95, 2861 (1962) 又は特開昭61-112072号公報に記載の方法で合成することができる。

【0031】式(7)で表されるピラゾール系化合物は、例えば、アルクイフ・フォー・ケミ (Arkiv for Kemi), 8, 52, p. 523 (1955) 又はアクタ・ヘミカ・スカンジナビカ (Acta. Chem. Scand.), 16, p. 2395 (1962) に記載の方法で合成することができる。

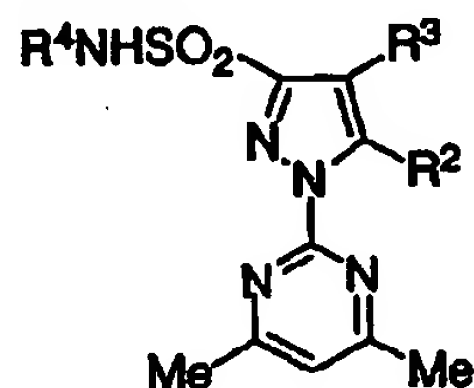
【0032】

【実施例】次に本発明化合物の製造を例を挙げて具体的に説明する。

【実施例1】メチル3-(2, 6-ジクロロフェニルスルファモイル)-1-(4, 6-ジメチルピリミジン-2-イル)-ピラゾール-4-カルボキシレート (化合物番号1) の製造

乾燥ピリジン20mlに溶解した2, 6-ジクロロアニリン (1.2g) 及び4-ジメチルアミノピリジン (0.1g) の攪拌溶液にメチル3-クロロスルホニル-1-(4, 6-ジメチルピリミジン-2-イル)-ピラゾール-4-カルボキシレート2.6gを少しずつ加えた。25℃で12時間経過した後、反応液を70℃に加熱し、更に3時間攪拌を続けた。反応終了後反応液を減圧下溶媒を留去し、水100mlを加えたのち、飽和炭酸ナトリウム水溶液200mlとクロロホルム200mlを加えた。生じた結晶及び水層を分取し、濃塩酸を使って酸性とし生じた結晶をろ取した。得られた結晶をジエチルエーテルで洗浄し乾燥させて標記目的化合物2.2gを得た。融点 275~278℃

【0033】【実施例2】メチル3-(2, 6-ジクロロフェニルスルファモイル)-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-ピラゾール-4-カルボキシレート (化合物番号17) の製造



但し、Q<sub>1</sub> =

【0036】

化合物番号	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	融点 (°C)
1	H	CO <sub>2</sub> Me	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	275-278
2	H	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	241-242
3	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	241-244

実施例1で得られた化合物5gをエチルアルコール100ml及び水100mlに溶解し、水酸化ナトリウム3gを加えて還流条件下5時間攪拌を続けた。反応終了後反応液を減圧下エチルアルコールのほとんどを留去し、水100mlを加えたのち、濃塩酸を使って酸性とし生じた結晶をろ取した。得られた結晶をジエチルエーテルで洗浄し乾燥させた後、塩化チオニル50mlに加えて還流条件下5時間攪拌を続けた。反応終了後溶媒を減圧下完全に留去したのち、乾燥したメチルアルコールを加えて還流条件下1時間攪拌を続けた。反応終了後反応液を減圧下メチルアルコールのほとんどを留去し、クロロホルム300ml及び水100mlを加えた。クロロホルム層を分取して無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去してメチル3-(2, 6-ジクロロフェニルスルファモイル)-1-H-ピラゾール-4-カルボキシレート2.6gを得た。融点 227~230℃

得られたメチル3-(2, 6-ジクロロフェニルスルファモイル)-1-H-ピラゾール-4-カルボキシレート0.6gを、乾燥ジメチルホルムアミド20mlに溶解し、水素化ナトリウム0.15gを室温に加えた。室温で30分間攪拌したのちに4, 6-ジメトキシ-2-メタンスルホニルピリミジン0.38gを加え反応液を70℃に加熱し、更に3時間攪拌を続けた。反応終了後反応液を減圧下溶媒を留去し、クロロホルム200mlを加え希塩酸水で洗浄したのちクロロホルム層を取り、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を減圧下留去した。メチルアルコール10mlを加えて生じた結晶をろ取し乾燥させて標記目的化合物0.7gを得た。融点 258~261℃

【0034】実施例1及び実施例2と同様な方法により得られた本発明化合物を第1表から第5表に示す。

【第1表】

【0035】

【化5】

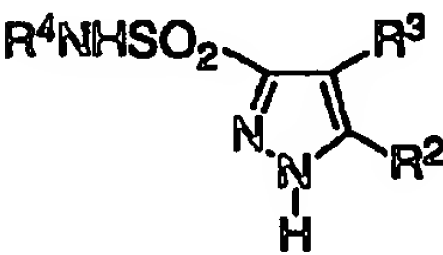


(12)

22

21				
4	H	CN	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	250-252
5	H	CN	2,6-F <sub>2</sub> -Ph	269-271
6	H	CONMe <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	252-255
7	H	CONHMe	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	254-257
8	H	CONH <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	279-280
9	H	CONHNHCOMe	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	177-180
10	H	Q <sub>1</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	272-275
11	Me	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	227-230
12	Me	COMe	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	235-238
13	Me	C(Me)=NOMe	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	220-223
14	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	256-259

【0037】 (第2表) \* 【0039】  
【0038】  
【化6】

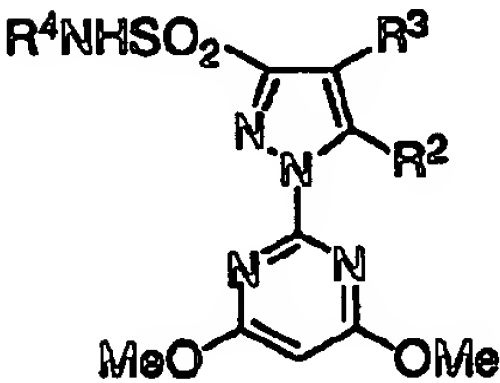


\* 20

化合物 番 号	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	融 点 (℃)
15	H	CO <sub>2</sub> Me	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	227-230
16	Me	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	218-221

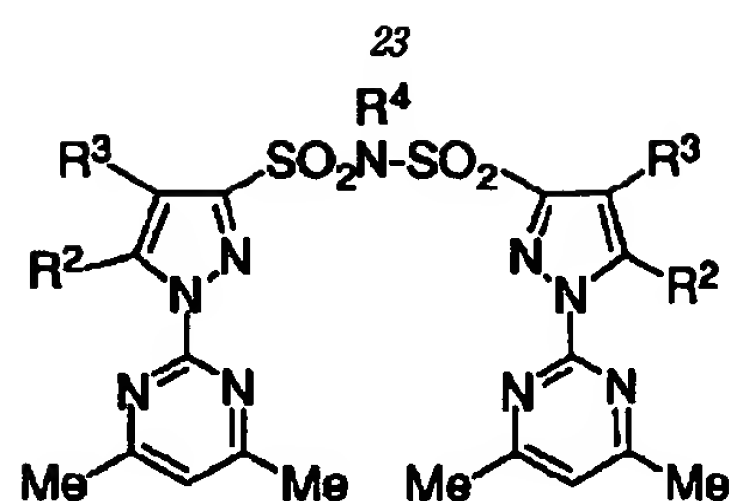
【0040】 (第3表) 【0042】  
【0041】  
【化7】

30



化合物 番 号	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	融 点 (℃)
17	H	CO <sub>2</sub> Me	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	258-261
18	Me	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	253-255

【0043】 (第4表)  
【0044】  
【化8】



\* 【0045】

\*

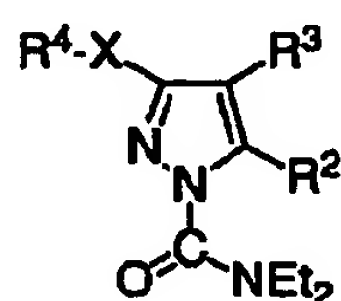
化合物 番号	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	融 点 (°C)
19	H	CN	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	262-265
20	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	277-280

【0046】 (第5表)

※ 【0048】

【0047】

【化9】



20

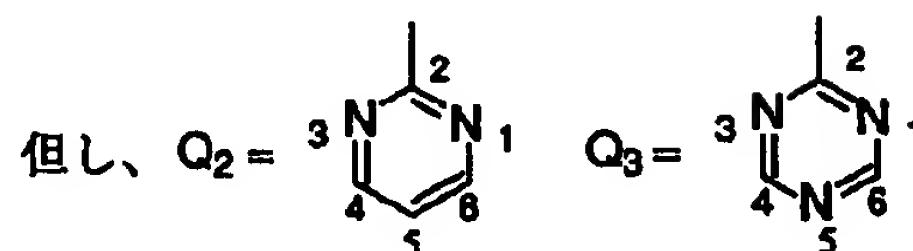
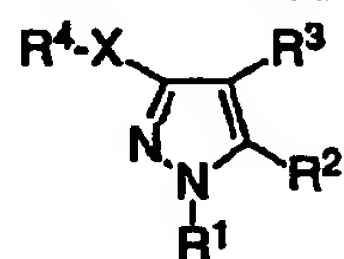
※

化合物 番号	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>	融 点 (°C)
21	H	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>2</sub> S	Ph	65-67
22	H	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	Ph	77-80
23	H	H	CH <sub>2</sub> S	Ph	油状
24	H	H	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub>	Ph	油状

【0049】次に前記実施例に準じて合成される化合物  
を前記実施例を含めて第6表に示す。但し本発明はこれ  
らに限定されるものではない。【第6表】

【0050】

【化10】



【0051】

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph

25

26

4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph

【0052】

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph

【0053】

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph

4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>2</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph

【0054】

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-Me <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph

【0055】

50

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4,6-OMe <sub>2</sub> -Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> i-Pr	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	COMe	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	CN	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	H	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph

【0056】

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
4-OMe-6-Me-Q <sub>3</sub>	H	Q <sub>1</sub>	NHSO <sub>2</sub>	2,6-F <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	COMe	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CN	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	COMe	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CN	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	OSO <sub>2</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	COMe	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph

31				
CONEt <sub>2</sub>	H	CN	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	COMe	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph

32

【0057】

〔第6表続き〕

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X	R <sup>4</sup>
CONEt <sub>2</sub>	H	CN	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	SO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Me	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	COMe	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	CN	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph
CONEt <sub>2</sub>	H	SO <sub>2</sub> Me	OSO <sub>2</sub>	2,4,6-Me <sub>3</sub> -Ph

【0058】本発明化合物を農園芸用除草剤として使用するにあたっては、一般には適当な担体、例えばクレー、タルク、ベントナイト、珪藻土等の固体担体あるいは水、アルコール類（メタノール、エタノール等）、芳香族炭化水素類（ベンゼン、トルエン、キシレン等）、塩素化炭化水素類、エーテル類、ケトン類、エステル類（酢酸エチル等）、酸アミド類（ジメチルホルムアミド等）などの液体担体と混用して適用することができ、所望により乳化剤、分散剤、懸濁剤、浸透剤、展着剤、安定剤などを添加し、液剤、乳剤、水和剤、粉剤、粒剤、フロアブル剤等任意の剤型にて実用に供することができる。また、必要に応じて製剤又は撒布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤などと混合施用してもよい。混合する除草剤の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック（Farm Chemicals Handbook）1990年版に記載されている化合物などがある。その中からいくつかを挙げれば、アトラジン、シアナジン、アラクロールメトラクロール、EPTC、2,4-D、ブチレート、ジカンパ、プロモキシニル及びトリジファンなどが挙げられる。その施用量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール当たり0.001~10kg程度が適当である。

【0059】つぎに本発明化合物を有効成分とする除草剤の配合例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

〔配合例1〕 水和剤

本発明化合物番号 1 ————— 60部

ジークライト PFP ————— 33部

（カオリン系クレー：ジークライト工業（株）商品名）

ソルポール5039 ————— 5部

（非イオン系界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

カーブックス（固結防止剤） ————— 2部

（ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名）

以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

30 【0060】〔配合例2〕 乳剤

本発明化合物番号 1 ————— 1.5部

キシレン ————— 78.5部

N,N-ジメチルホルムアミド ————— 15部

ソルポール2680 ————— 5部

（非イオン系界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名）

以上を均一に混合して乳剤とする。

【0061】〔配合例3〕 フロアブル剤

本発明化合物番号 1 ————— 40部

40 アグリゾール B-710 ————— 10部

（非イオン性界面活性剤：花王（株）商品名）

ルノックス1000C ————— 0.5部

（陰イオン界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名）

1%ロドポール水 ————— 20部

（増粘剤：ローン・ブーラン社商品名）

水 ————— 29.5部

以上を均一に混合して、フロアブル剤とする。

【0062】〔配合例4〕 粒剤

本発明化合物番号 1 ————— 1部

50 ベントナイト ————— 55部

タ ル ク

44部

以上を均一に混合粉碎して後、少量の水を加えて攪拌混合捏和し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤にする。

【0063】なお、本発明化合物は、畑地、水田、果樹園などの農園芸以外に運動場、空地、路線端など非農耕地における各種雑草の防除にも運用することができ、その施用薬量は適用場面、施用時期、対象草種等により差異はあるが一般には1ヘクタール当たり0.001~5kg程度になるように散布するのが適当である。次に本発

明化合物の除草効果について、具体的に試験例を挙げて説明する。

【0064】〔試験例-1〕 土壌処理による除草効果試験

縦15cm、横22cm、深さ6cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、イヌホウズキ、ハキダメギク、イヌガラシ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタを混播し、約1.5cm覆土した後、有効成分量が所定の割合となるように土壌表面に均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に応じて適宜調整された水和剤を水で希釈して小型スプレーで散布した。薬液散布3週間後に作物及び各種雑草に対する除草効果を下記の判定基準に従い目視により観察調査した。結果を第7表に示す。

判定基準

〔第7表〕 土壌処理による除草効果試験

化合物 番号	薬 量 (kg/ha)	A	B	C	a	b	c	d	e
1	0.63	5	5	5	0	0	0	0	0
2	0.63	5	5	5	0	0	0	0	0
4	2.5	5	5	5	0	0	0	0	0
14	0.63	5	5	5	1	0	0	0	0
17	0.63	5	5	5	0	0	0	0	0

【0068】

〔第8表〕 茎葉処理による除草効果試験

化合物 番号	薬 量 (kg/ha)	A	B	C	a	b	c	d	e	f
1	0.63	5	5	5	0	0	0	4	4	4
2	0.63	5	5	3	0	0	0	3	0	1
4	2.5	5	5	5	0	0	0	0	0	4
6	2.5	5	5	5	0	0	0	4	3	1
14	0.63	4	4	5	0	0	0	1	0	0
17	2.5	5	5	5	0	0	0	3	1	3

5：殺草率90%以上（ほとんど完全枯死）

4：殺草率70~90%

3：殺草率40~70%

2：殺草率20~40%

1：殺草率 5~20%

0：殺草率 5%以下（ほとんど効力なし）

【0065】〔試験例-2〕 茎葉処理による除草効果試験

縦15cm、横22cm、深さ6cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、イヌホウズキ、ハキダメギク、イヌガラシ、イネ、トウモロコシ、コムギ、ダイズ、ワタ、ビートの種子をそれぞれスポット状に播種し約1.5cm覆土した。各種植物が2~3葉期に達したとき、有効成分量が所定の割合となるように茎葉部へ均一に散布した。散布の際の薬液は、前記配合例等に応じて適宜調整され水和剤を水で希釈して小型スプレーで各種植物の茎葉部全面に散布した。薬液散布3週間後に作物及び各種雑草に対する除草効果を試験例1の判定基準に従い目視により観察調査した。結果を第8表に示す。

【0066】表中の記号は以下を表す。A：イヌホウズキ、B：ハキダメギク、C：イヌガラシ、a：イネ、b：トウモロコシ、c：コムギ、d：ダイズ、e：ワタ、f：ビート

【0067】



フロントページの続き

(72)発明者 縄巻 勲  
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化  
学工業株式会社生物科学研究所内

(72)発明者 渡辺 重臣  
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化  
学工業株式会社生物科学研究所内  
(72)発明者 石川 公広  
埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化  
学工業株式会社生物科学研究所内

